



BREVET D'INVENTION

CERTIFICAT D'UTILITÉ - CERTIFICAT D'ADDITION

COPIE OFFICIELLE

Le Directeur général de l'Institut national de la propriété industrielle certifie que le document ci-annexé est la copie certifiée conforme d'une demande de titre de propriété industrielle déposée à l'Institut.

Fait à Paris, le 0 2 AVR. 2001

Pour le Directeur général de l'Institut national de la propriété industrielle Le Chef du Département des prévets

Martine PLANCHE

INSTITUT
NATIONAL DE
LA PROPRIETE

SIEGE 26 bis, rue de Saint Petersbourg 75800 PARIS cedex 08 Téléphone : 01 53 04 53 04 Télécopie : 01 42 93 59 30 http://www.inpi.fr

			. •
	v.		



BREVET D'INVENTIONCERTIFICAT D'UTILITÉ

cerfa N° 11354*01

Code de la propriété intellectuelle - Livre VI

PATIONAL DE LA PROPRIETE

26 bis, rue de Saint Pétersbourg

75800 Paris Cedex 08

Téléphone : 01 53 04 53 04 Télécopie : 01 42 94 86 54

REQUÊTE EN DÉLIVRANCE 1/2

			Cet imprimé est à remplir lisiblement à l'encre noire	DB 540 W /260899
REMISE DES PIECES	20 Servé à l'INPI		1 NOM ET ADRESSE DU DEMANDEUR OU DU MANI	
DATE /5 INPLP	ARIS	:	À QUI LA CORRESPONDANCE DOIT ÊTRE ADRE	SSEE
UEV			L'OREAL - D.P.I	•
N° D'ENREGISTREMENT	0007343		Catherine RASSON	
NATIONAL ATTRIBUÉ PAR I			6 rue Bertrand Sincholle 92585 CLICHY CEDEX	
date de dépôt attribué Par l'inpi	0 8 JUIN 20)00	FRANCE	
Vos références p	our ce dossier			•
(facultatif) OA001	33/CR			
Confirmation d'u	n dépôt par télécopie [☐ N° attribué par l'I	INPI à la télécopie	
2 NATURE DE L	A DEMANDE	Cochez l'une des	4 cases suivantes	
Demande de b	prevet	×		
Demande de c	ertificat d'utilité			
Demande divis	sionnaire			·
·	Demande de brevet initiale	N°	Date / /	
_		N°	Date / /	
	nde de certificat d'utilité initiale	'\	- Date 1 1	
	d'une demande de n Demande de brevet initiale	∐ _{N°}	Date / /	
·	NVENTION (200 caractères ou			
4 DÉCLARATIO		Pays ou organisation	on / N°	
OU REQUÊTE	DU BÉNÉFICE DE	Pays ou organisation		
LA DATE DE	DÉPÔT D'UNE	Date//		
DEMANDE A	NTÉRIEURE FRANÇAISE	Pays ou organisation	on	
	•	Date//	/N°	
		☐ S'ilyad'a	utres priorités, cochez la case et utilisez l'imprimé	«Suite»
5 DEMANDEU	R	☐ S'il y a d'a	autres demandeurs, cochez la case et utilisez l'impr	imé «Suite»
Nom ou dénor	mination sociale	L'OREAL		
Prénoms				
Forme juridiqu	Je	S.A		
N° SIREN				
Code APE-NAI	F			
Adresse	Rue	14 rue Royale		
	Code postal et ville	75008 PAR	RIS	
Pays		FRANCE		
Nationalité		française		
N° de télépho		01 47 56 81 56		
N° de télécop		01 47 56 73 88		
Adresse élect	ronique (facultatif)			



BREVET D'INVENTION CERTIFICAT D'UTILITÉ

REQUÊTE EN DÉLIVRANCE 2/2

REMISE DE	ESPIECES	20 Reservé à l'INPI	<u>.</u> .	7	
	INPLP	ARIS			
LIEV		0007343			,
	GISTREMENT				
NATIONAL	ATTRIBUÉ PAR L	'INPI		<u> </u>	DB 540 W /260899
Vos réf (facultat		our ce dossier :	OA00133/CR		
6 M/	ANDATAIRE				
No	m		RASSON		
Pré	énom		Catherine		
Cal	binet ou So	ciété	L'OREAL		
	de pouvoir lien contrac	permanent et/ou tuel			
Adı	resse	Rue	6 rue Bertrand S		
		Code postal et ville	92585 CI	ICHY	
		ne (facultatif)	01 47 56 81 56		
	de télécopi		01 47 56 73 88		
Adı	resse électro	onique (facultatif)			
☑ IN/	VENTEUR (S)	<u> </u>		
Les	s inventeurs	sont les demandeurs	Oui Non Dans	e cas fournir une désign	ation d'inventeur(s) séparée
8 RA	PPORT DE	RECHERCHE	Uniquement po	ur une demande de breve	t (y compris division et transformation)
		Établissement immédiat ou établissement différé	×		
Pa	iement éche	elonné de la redevance	Paiement en tr Oui Non	ois versements, uniquemo	ent pour les personnes physiques
RÉ	DUCTION	DU TAUX	Uniquement po	ur les personnes physique	98
_ DE	S REDEVA	NCES	Requise pour	la première fois pour cette i	invention (joindre un avis de non-imposition)
			· ·	ieurement à ce dépôt (join ention ou indiquer sa référenc	dre une copie de la décision d'admission ce):
		utilisé l'imprimé «Suite», ombre de pages jointes	·		
					VISA DE LA PRÉFECTURE
OL (N	J DU MANI	DU DEMANDEUR DATAIRE ité du signataire) Catherine RASSON	> Rason		OU DE L'INPI

La loi n°78-17 du 6 janvier 1978 relative à l'informatique, aux fichiers et aux libertés s'applique aux réponses faites à ce formulaire. Elle garantit un droit d'accès et de rectification pour les données vous concernant auprès de l'INPI.



BREVET D'INVENTION



cerfa N° 11235'02

Code de la propriété intellectuelle - Livre VI

DÉPARTEMENT DES BREVETS

26 bis, rue de Saint Pétersbourg 75800 Paris Cedex 08 Téléphone : 01 53 04 53 04 Télécopie : 01 42 93 59 30 DÉSIGNATION D'INVENTEUR(S) Page N° 1.../ 1... (Si le demandeur n'est pas l'inventeur ou l'unique inventeur)

Cet imprimé est à remplir lisiblement à l'encre noire DB 113 W /260899 OA00133/CR Vos références pour ce dossier (facultatif) N° D'ENREGISTREMENT NATIONAL 0007343 TITRE DE L'INVENTION (200 caractères ou espaces maximum) Utilisation du phytantriol comme agent anti-pollution, notamment dans une composition cosmétique LE(S) DEMANDEUR(S): L'OREAL 14 rue Royale **75008 PARIS FRANCE** DESIGNE(NT) EN TANT QU'INVENTEUR(S) : (Indiquez en haut à droite «Page N° 1/1» S'il y a plus de trois inventeurs, utilis z un formulaire identique et numérotez chaque page en indiquant le nombre total de pages). **BIATRY** Nom Bruno **Prénoms** 16/18 avenue de la République Rue Adresse **VINCENNES** Code postal et ville 94300 Société d'appartenance (facultatif) Nom Prénoms Rue Adresse Code postal et ville Société d'appartenance (facultatif)

DATE ET SIGNATURE(S)
DU (DES) DEMANDEUR(S)
OU DU MANDATAIRE
(Nom et qualité du signatair)
Le 15/06/00

Société d'appartenance (facultatif)

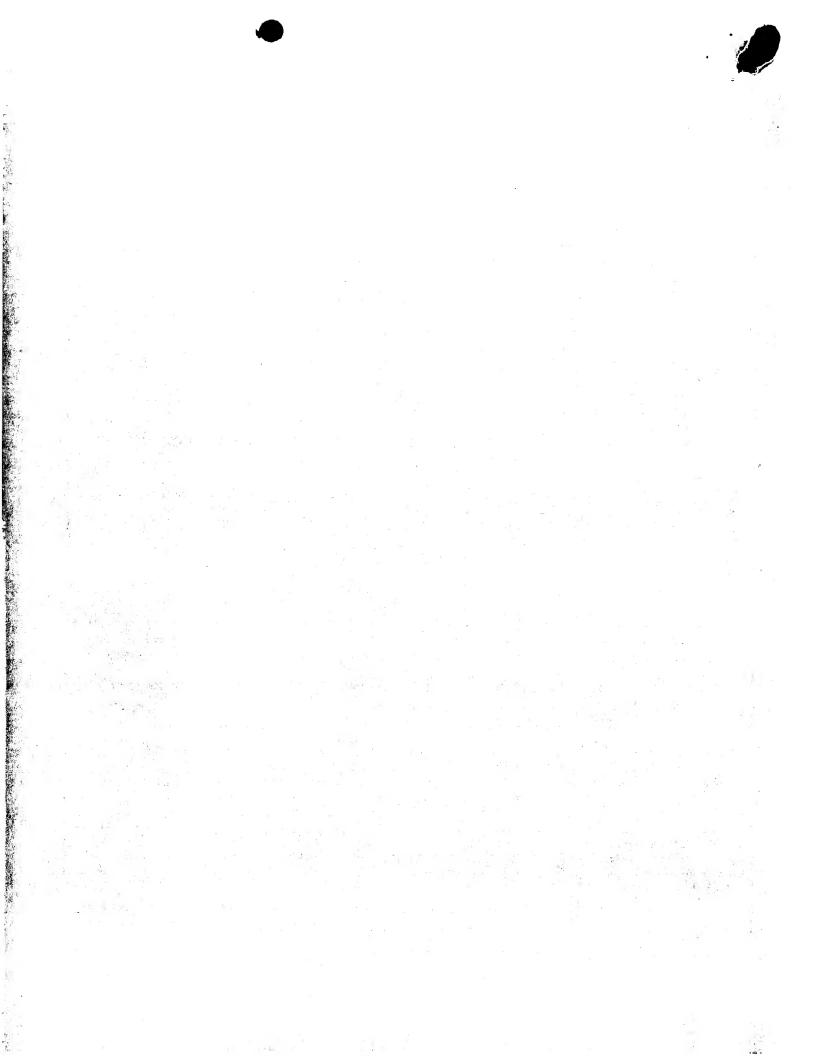
Rue

Code postal et ville

Catherine RASSON

Nom Prénoms

Adresse



La présente demande se rapporte à l'utilisation en application topique, du phytantriol comme agent anti-pollution, notamment comme agent cosmétique anti-pollution, et à un procédé de traitement cosmétique en vue de protéger l'organisme contre les effets de la pollution, consistant à appliquer sur la matière kératinique, une composition contenant dans un milieu physiologiquement acceptable, une quantité efficace de phytantriol.

5

25

30

35

40

Certains milieux urbains sont régulièrement soumis à des pics de pollution.

L'individu dans son environnement quotidien et particulièrement en zone urbaine, peut être soumis à de multiples agressions au niveau des matières kératiniques, et notamment de la peau, du cuir chevelu et des cheveux, par différents polluants aériens.

Parmi les polluants pouvant exercer des effets délétères sur les matières kératiniques, les gaz toxiques tels que l'ozone, le monoxyde de carbone, les oxydes d'azote ou les oxydes de soufre, sont l'un des constituants majeurs. Il a été constaté que ces gaz toxiques favorisent la desquamation des matières kératiniques, les rendent sales et ternes. De même, ces gaz entraînent une asphyxie cellulaire au niveau desdites matières kératiniques.

On sait par ailleurs que les métaux lourds (plomb, cadmium, mercure) sont des polluants atmosphériques dont les émissions ont notablement augmenté, notamment en milieu urbain ou industriel. Outre certains effets toxiques qui leur sont propres, les métaux lourds ont la propriété de diminuer l'activité des moyens de défense cellulaire contre les radicaux libres [voir par exemple R.S. Dwivedi, J. Toxicol. Cut. & Ocular Toxical. 6(3), 183-191 (1987)]. Ainsi, les métaux lourds aggravent les effets toxiques des polluants gazeux en diminuant l'efficacité des moyens naturels de défense, et provoquent une accélération du phénomène de vieillissement cellulaire. Ceci est vrai en particulier pour les matières kératiniques et notamment la peau, le cuir chevelu et les cheveux qui sont en contact direct et permanent avec le milieu extérieur.

Ainsi, les effets nocifs de la pollution sur les matières kératiniques affectent la respiration cellulaire et se traduisent par un vieillissement accéléré de la peau, avec un teint terne et la formation précoce de rides ou ridules, et aussi par une diminution de la vigueur des cheveux qui prennent aussi un aspect terne. En outre, du fait de la pollution, peau et cheveux se salissent plus rapidement. De plus, la pollution peut provoquer des phénomènes d'allergie sur la peau.

Ainsi, il existe le besoin de compositions permettant d'éviter les effets néfastes dus aux polluants (gaz ou métaux lourds), de façon à protéger les matières kératiniques de ces polluants externes.

Il a été maintenant constaté de manière tout à fait surprenante que le phytantriol permettait de protéger les matières kératiniques des effets des polluants se trouvant dans l'atmosphère.

Le phytantriol ou 3,7,11,15-tétraméthyl-1,2,3-hexadecanetriol est un composé connu, notamment commercialisé sous la dénomination de « Phytantriol-63926 » par la Société Roche.

- Certes, l'utilisation du phytantriol en application topique est connue pour le soin de la peau (voir les documents GB-A-923400 et EP-A-0 584 315), comme agent hydratant (voir les documents GB-A-2,304,573 et EP-A-0 343 444), comme modulateur de pénétration (voir les documents EP-A-0 579 079 et GB-A-2,304,573). On connaît également son utilisation dans le domaine capillaire (voir les documents GB-A-944834, US-A-5,776,443 et WO-A-00/15181) et dans le maquillage (voir les documents FR-A-2,675,045 et US-A-5,102,654). Toutefois, aucun document ne décrit que le phytantriol puisse avoir des propriétés de protection des fibres kératiniques contre la pollution.
- Ainsi, la présente invention a pour objet l'utilisation cosmétique du phytantriol comme agent anti-pollution, dans une composition pour application topique sur les matières kératiniques.
- L'invention a aussi pour objet l'utilisation du phytantriol pour la préparation d'une composition à application topique destinée à protéger la matière kératinique contre les effets nocifs de la pollution.
 - On entend ici par « application topique » une application externe sur les matières kératiniques, que sont notamment la peau, le cuir chevelu, les cils, les sourcils, les ongles et les muqueuses.

25

30

35

40

45

Le phytantriol peut être présent dans la composition pour application topique, en une quantité allant par exemple de 0,001 à 20 % en poids et de préférence de 0,1 à 10 % en poids par rapport au poids total de la composition.

Le phytantriol utilisé selon l'invention peut être incorporé notamment dans des compositions pouvant se présenter en particulier sous forme d'émulsions huile-dans-eau (H/E) ou eau-dans-huile (E/H) ou sous forme de particules de gel cubique, ces dernières pouvant être utilisées seules ou incorporées dans une émulsion.

Le terme de gel cubique désigne des gels transparents, isotropes en lumière polarisée, se présentant sous forme de phase cristal liquide cubique. Les phases cubiques sont organisées d'une manière bi-polaire en domaines hydrophile et lipophile distincts, en contact étroit et formant un réseau tridimensionnel thermodynamiquement stable. Une telle organisation a été notamment décrite dans Luzzati (1968), « Biological Membranes » (Chapman, D. Ed.), vol 1, 71-123 et dans Mariani et coll. (1988), J. Mol. Biol., 204, 165-189, ainsi que dans "La Recherche" (1992), Vol.23, 306-315. Selon l'arrangement des domaines hydrophile et lipophile, la phase cubique est dite de type normal ou inverse. Le terme de gel cubique utilisé selon la présente invention regroupe bien entendu les gels présentant les différents types de phases cubiques. Tous les types de gel cubique peuvent être utilisés selon la présente invention.

Les particules de gel cubique contenant du phytantriol peuvent être présentes dans la composition pour application topique utilisée selon l'invention, en une quantité allant par exemple de 0,1 à 20 % en poids et de préférence de 0,1 à 10 % en poids par rapport au poids total de la composition.

5

10

15

20

35

40

45

De manière avantageuse, les particules de gel cubique contenant le phytantriol sont en dispersion aqueuse dans la composition pour application topique. Ces particules peuvent être notamment obtenues selon le mode préféré de réalisation décrit ci-dessous.

Selon ce mode de réalisation, les particules se trouvent en dispersion aqueuse et sont essentiellement formées par (i) 0,1 à 15 % en poids par rapport au poids total de la composition, de phytantriol ou d'un mélange de phytantriol avec un composé choisi parmi les dérivés N-2-alcoxycarbonyles de N-méthylglucamine et les monoglycérides d'acide gras insaturé, et (ii) 0,05 à 3 % en poids par rapport au poids total de la composition, d'au moins un agent dispersant et stabilisant, ledit agent étant choisi parmi les agents tensioactifs hydrosolubles à température ambiante, contenant une chaîne grasse, saturée ou insaturée, linéaire ou ramifiée, ayant de 8 à 22 atomes de carbone. Les pourcentages sont exprimés ici par rapport à la quantité totale de la composition contenant les particules de gel cubique à base de phytantriol.

Selon ce mode de réalisation des particules de gel cubique utilisées selon l'invention, la proportion pondérale relative en phytantriol par rapport au poids à l'agent dispersant et stabilisant (ii) peut aller par exemple de 2 à 200, et est de préférence inférieure ou égale à 50.

Parmi les dérivés N-2-alcoxycarbonyles de N-méthylglucamine pouvant être utilisés en mélange avec le, phytantriol, on peut notamment citer ceux, répondant à la formule (I) suivante :

dans laquelle R représente un radical alkyle ramifié comportant de 6 à 18 atomes de carbone.

Parmi ceux-ci, on peut notamment mentionner la N-2-hexyldécyloxycarbonyl-N-méthyl-glucamine, la N-2-éthylhexyloxycarbonyl-N-méthyl-glucamine, la N-2-butyloctyloxycarbonyl-N-méthyl-glucamine et leurs mélanges.

Les composés de formule (I) tels que définis ci-dessus sont décrits et peuvent être préparés selon le procédé décrit dans le document EP-A-711540 cité ici pour référence. Ce procédé comprend notamment les étapes consistant :

(a) à dissoudre dans un mélange d'eau et d'un solvant organique, de la N-méthylglucamine, le solvant pouvant être par exemple le tétrahydrofuranne, (b) à disperser dans le mélange obtenu précédemment, du bicarbonate de sodium, en une proportion appropriée correspondant environ à quatre fois la proportion molaire de N-méthyl-glucamine,

(c) à introduire alors dans le mélange réactionnel obtenu, un chloroformiate d'alkyle, le radical alkyle étant en C6-C18, en une proportion appropriée, généralement équimolaire par rapport à celle de N-méthyl-glucamine, puis à laisser réagir le mélange, et

(d) à filtrer le mélange réactionnel obtenu après l'étape (c), à recueillir le résidu pâteux obtenu par filtration, puis à le dissoudre dans de l'acétone en vue de sa cristallisation à une température de l'ordre de 5°C. Après filtration, les cristaux du dérivé N-2-alcoxycarbonyle de N-méthylglucamine formé sont essorés et séchés sous vide.

Dans le cas où l'on utilise du phytantriol en mélange avec un ou des composés de formule (I), ce mélange comprend de préférence une quantité de phytantriol allant de 1 à 40 % en poids et mieux de 10 à 30 % en poids par rapport au poids du mélange, et une quantité de dérivé N-2-alcoxycarbonyle de N-méthylglucamine de formule (I) allant de 60 à 99 % en poids et mieux de 70 à 90 % en poids par rapport au poids du mélange.

Les monoglycérides d'acide gras insaturé pouvant être utilisés en mélange avec le phytantriol pour la préparation de particules de gel cubique sont de préférence ceux ayant une chaîne grasse insaturée comportant de 16 à 22 atomes de carbone. Parmi ceux-ci, on peut notamment citer le monooléate de glycéryle ou monooléine et le monolinoléate de glycéryle ou monolinoléine. On peut bien entendu utiliser, pour préparer les dispersions de particules de gel cubique, un mélange de monoglycérides tels que définis précédemment ainsi qu'un mélange de monoglycérides d'acide gras insaturé et de monoglycérides d'acide gras saturé, la proportion en monoglycérides d'acide gras saturé étant cependant de préférence inférieure à celle de monoglycérides d'acide gras insaturé.

Dans le cas où l'on utilise du phytantriol en mélange avec des monoglycérides d'acide gras insaturé, ce mélange comprend de préférence une quantité de phytantriol allant de 1 à 50 % en poids et mieux de 10 à 30 % en poids par rapport au poids total du mélange et une quantité de un monoglycéride d'acide gras insaturé en une proportion de 50 à 99 % en poids et mieux de 70 à 90 % en poids par rapport au poids du mélange.

L'agent dispersant et stabilisant (ii) des particules de gel cubique est de 40 préférence choisi parmi :

- (1) les alkyl ou alcényl éthers ou esters de polyol,
- (2) les amino-acides N-acylés et leurs dérivés, et les peptides N-acylés par un radical alkyle ou alcényle, et leurs sels,
- (3) les alkyl ou alcényl éthers ou esters sulfates, leurs dérivés et leurs sels.
- 45 (4) les alkyl ou alcényl éthers ou esters gras polyoxyéthylénés,
 - (5) les acides alkyl ou alcényl carboxyliques polyoxyéthylénés et leurs sels,
 - (6) les N-alkyl ou alcényl bétaïnes.

5

10

15

20

25

30

35

(7) les alkyl ou alcényl triméthylammonium et leurs sels, et

(8) leurs mélanges.

5

10

15

30

35

40

Dans les composés ci-dessus énumérés, les radicaux alkyle et alcényle ont de 8 à 22 atomes de carbone et peuvent se présenter sous forme de mélanges.

- (1) Comme alkyl ou alcényl éthers ou esters de polyol, on peut citer notamment :
- (a) les alkyl ou alcényl esters de sorbitan polyoxyéthylénés par au moins 20 motifs d'oxyde d'éthylène tels que le palmitate de sorbitan 20 OE ou Polysorbate 40 commercialisé sous la dénomination de « Montanox 40 DF » par la Société Seppic, et le laurate de sorbitan 20 OE ou Polysorbate 20 commercialisé sous la dénomination de « Tween 20 » par la Société ICI,
- (b) les alkyl ou alcényl esters de polyglycérol comportant au moins 10 motifs dérivés du glycérol, oxyéthylénés ou non, tels que le polyglycéryl-10 laurate commercialisé sous la dénomination de « Decaglyn 1-L » par la Société Nikko Chemicals.
- (c) les alkyl ou alcényl éthers de polyglycérol, tels que le polyglycéryl-3 hydroxylauryléther commercialisé sous la dénomination de « Chimexane NF » par la Société Chimex, et
- (d) les alkyl ou alcényl éthers ou esters de mono ou polysaccharides, tels que ceux dérivant du glucose, du fructose, du galactose, du maltose ou du lactose et notamment les monoesters en 1- et 6- du D-fructose, du décylglucose et du décylpolyglucose.
- (2) Comme amino-acides N-acylés et leurs dérivés, et les peptides N-acylés par un radical alkyle ou alcényle, et leurs sels, on utilise de préférence ceux pour lesquels le radical alkyle ou alcényle comporte au moins 12 atomes de carbone.
 - Par amino-acides, on entend selon l'invention les alpha-, bêta- ou gamma-aminoacides. Comme sels d'amino-acides N-acylés, on peut citer par exemple ceux de N-acylglutamate, tels que le cocoylglutamate de monosodium, le lauroylglutamate de monosodium, l'alcoyl C14-C20 glutamate de disodium (le radical alcoyle C14-C20 dérivant du suif hydrogéné), commercialisés respectivement sous les dénominations de « Acylglutamate CS-11 », de « Acylglutamate LS-11 » et de « Acylglutamate HS-21 » par la Société Ajinomoto. On peut encore citer les lysines N-acylées telles que la lauroyl-lysine commercialisée sous la dénomination de « Amihope LL » par la Société Ajinomoto. Les dérivés d'amino-acides N-acylés et leurs sels sont de préférence les sarcosinates N-acylés tels que le lauroylsarcosinate de sodium commercialisé sous la dénomination de « Oramix L30 » myristoylsarcosinate sodium de le Société Seppic, palmitoylsarcosinate de sodium commercialisés respectivement sous dénominations de « Nikkol Sarcosinate MN » et de « Nikkol Sarcosinate PN » par la Société Nikko Chemicals.
- Parmi les peptides N-acylés, on peut citer ceux dérivés de tout ou partie du collagène ou de la kératine, tels que le lauroyl collagène de sodium et la palmitoyl kératine commercialisés sous les dénominations de « Proteol B 30 » et de « Lipacide PK » par la Société Seppic.

- (3) Parmi les alkyl ou alcényl éthers ou esters sulfates, leurs dérivés et leurs sels, on utilise de préférence ceux pour lesquels le radical alkyle ou alcényle comporte au moins 12 atomes de carbone.
- Parmi les alkyl ou alcényl éthers sulfates, on utilise de préférence les sels d'alkyl éther sulfate et notamment le lauryléther sulfate de sodium. Parmi les alkyl ou alcényl esters sulfates, on peut citer par exemple les esters de l'acide iséthionique ainsi que ses sels, et notamment le cocoyl iséthionate de sodium commercialisé sous la dénomination de « Geropon AC 78 » par la Société Rhône Poulenc.

10

15

20

25

30

35

- (4) Parmi les alkyl ou alcényl éthers ou esters gras polyoxyéthylénés, on utilise de préférence ceux pour lesquels le radical alkyle ou alcényle comporte au moins 12 atomes de carbone. Ceux particulièrement préférés ont au moins 20 motifs d'oxyde d'éthylène, tels que par exemple le PEG-20 stéarate, le laureth-23, l'oleth-20 et le PEG-25 phytostérol.
- (5) Parmi les acides alkyl ou alcényl carboxyliques polyoxyéthylénés et leurs sels, on utilise de préférence ceux comportant au moins 10 motifs d'oxyde d'éthylène, tels que par exemple l'acide laureth-10 carboxylique et l'acide oleth-10 carboxylique.
- (6) Parmi les N-alkyl ou alcényl bétaïnes, on utilise de préférence celles pour lesquelles le radical alkyle ou alcényle comporte au moins 12 atomes de carbone telles que par exemple la lauryl-amidopropyl bétaïne et l'oléyl-amidopropyl bétaïne.
- (7) Parmi les alkyl ou alcényl triméthylammonium et leurs sels, on utilise de préférence ceux pour lesquels le radical alkyle ou alcényle comporte au moins 12 atomes de carbone. Comme sels, on utilise de préférence les bromures et chlorures tels que le chlorure de cocoyltriméthylammonium et le bromure de cétyltriméthylammonium.
- Selon un mode particulier de réalisation de l'invention, on peut ajouter dans la dispersion aqueuse contenant ces particules, un lipide amphiphile ionique non hydrosoluble, de préférence en une quantité allant de 0,0005 % à 5 % en poids et mieux de 0,001 % à 2 % en poids par rapport au poids total de la dispersion.
- Parmi les lipides amphiphiles ioniques non hydrosolubles, on peut notamment citer :
- (i) les phospholipides tels que les phospholipides naturels comme la lécithine de soja ou d'œuf, les phospholipides modifiés par voie chimique ou enzymatique comme la lécithine hydrogénée ou le sel de sodium de l'acide phosphatidique, et les phospholipides de synthèse comme la dipalmitoylphosphatidylcholine,
- (ii) les esters phosphoriques d'acide gras et leurs sels, notamment de sodium et de potassium, tels que le monocétyl phosphate commercialisé sous la dénomination de "Monafax 160" par la Société Mona, ainsi que le dimyristyl phosphate commercialisé sous la dénomination de « Mexoryl SY » par la Société Chimex,

(iii) les dérivés N-acylés de l'acide glutamique et leurs sels, tels que le stéaroylglutamate de monosodium commercialisé sous la dénomination de « Acylglutamate HS 11 » par la Société Ajinomoto, et le mélange cocoy, l-alcoyl C14-C20 glutamate de monosodium, le radical alcoyle C14-C20 dérivant du suif hydrogéné, commercialisé sous la dénomination de « Acylglutamate GS 11 » par la Société Ajinomoto,

(iv) le cétylsulfate de sodium commercialisé sous la dénomination de « Nikkol

SCS » par la Société Nikko Chemicals,

(v) le cocoyl monoglycéride sulfate de sodium commercialisé sous la dénomination de « Nikkol SGC 80 N » par la Société Nikko Chemicals, et (vi) les dérivés d'ammonium quaternaire non hydrosolubles tels que le chlorure de béhényltriméthylammonium, le chlorure de dilauryldiméthylammonium, le chlorure de distéaryl-diméthylammonium, le méthylsulfate de 4,5-dihydro 1-méthyl 2-alcoyl C14-C20 1-(2-alcoyl C14-C20 aminoéthyl)imidazolium, les radicaux alcoyles C14-C20 dérivant du suif hydrogéné, commercialisé sous la dénomination de « Rewoquat W75H » par la Société Rewo Chemische, le méthylsulfate de dialkylhydroxyéthylméthylammonium dont les radicaux alkyles dérivent du suif, hydrogéné ou non, commercialisé sous la dénomination de « Stepanquat VP 85 » par la Société Stepan et le « Quaternium-82 » commercialisé par la Société Seppic sous la dénomination de « Amonyl DM ».

L'incorporation de ces lipides amphiphiles ioniques non hydrosolubles confère aux particules de gel cubique une charge superficielle entraînant une répulsion électrostatique des particules entre elles.

25

30

35

5

10

15

20

Les particules de gel cubique telles que définies précédemment ont une taille qui peut être modulée par la nature et la concentration des composés les constituant. Généralement, ces particules ont une taille moyenne en nombre, mesurée à l'aide d'un granulomètre laser BI 90 de la Société Brookhaven Instruments Corporation, d'environ 0,05 µm à environ 1 µm, et de préférence inférieure ou égale à 0,5 µm.

Il est en outre possible d'incorporer dans les particules de gel cubique, divers types de composés actifs. En particulier, lesdites particules peuvent contenir un principe actif hydrophile ou lipophile. Bien entendu, grâce à la structure particulière des particules de gel cubique, il est possible d'incorporer dans celles-ci à la fois des principes actifs hydrophiles et lipophiles, même si ceux-ci présentent une certaine incompatibilité.

De préférence, les dispersions de gel cubique contenant du phytantriol peuvent être obtenues selon un procédé de préparation comprenant au moins deux étapes. La première étape consiste généralement à préparer une dispersion aqueuse de particules de gel cubique telles que définies précédemment, par fragmentation, à l'aide d'un homogénéiseur, d'un gel cubique composé tel que défini précédemment et d'eau, en présence éventuellement de lipides amphiphiles ioniques non hydrosolubles et/ou de principes actifs hydrophiles et/ou lipophiles et/ou d'un agent dispersant et stabilisant tels que définis précédemment. L'homogénéiseur peut être du type rotor-stator à fort gradient de cisaillement

comme le Virtis^R ou le Heidolph Diax 600^R ou un homogénéiseur haute pression fonctionnant entre 200 et 1.800 bars environ (20 à 180 MPa).

Il est bien entendu possible d'introduire, à ce stade de la préparation de la dispersion aqueuse des particules de gel cubique, divers additifs et/ou principes actifs dans la phase aqueuse. Après la formation des particules de gel cubique, l'agent dispersant et stabilisant se trouve, généralement, à l'extérieur desdites particules.

5

15

20

25

30

La deuxième étape consiste généralement ensuite à ajouter à ladite dispersion obtenue une phase huileuse contenant éventuellement certains additifs et/ou principes actifs lipophiles et à soumettre le mélange à une agitation mécanique qui peut être notamment réalisée à l'aide d'un homogénéiseur du même type que ceux définis ci-dessus.

Divers additifs et/ou principes actifs peuvent être également introduits à ce stade de la préparation. Par ailleurs, lorsque l'on souhaite préparer une dispersion gélifiée, dans une troisième étape, on ajoute généralement au mélange obtenu après la seconde étape, une solution aqueuse contenant un agent gélifiant.

Les compositions contenant du phytantriol, utilisées selon l'invention peuvent constituer notamment des compositions cosmétiques et dermatologiques. Elles contiennent pour une telle application, un milieu physiologiquement acceptable. On entend ici par « milieu physiologiquement acceptable », un milieu compatible avec la peau, les lèvres, le cuir chevelu, les cils, les yeux et/ou les cheveux. Ce milieu physiologiquement acceptable peut être plus particulièrement constitué d'eau et éventuellement d'un solvant organique physiologiquement acceptable choisis par exemple parmi les alcools inférieurs comportant de 1 à 4 atomes de carbone comme l'éthanol, l'isopropanol, le propanol, le butanol; les polyéthylène glycols ayant de 6 à 80 oxydes d'éthylène; les polyols comme le propylène glycol, l'isoprène glycol, le butylène glycol, la glycérine, le sorbitol. Le milieu physiologiquement acceptable de la composition selon l'invention a un pH compatible avec la peau, et de préférence allant de 3 à 8 et mieux de 5 à 7.

Selon un mode préférée de réalisation, les compositions utilisées dans la présente invention comportent en outre une phase huileuse, apportant notamment du confort et de la douceur lors de l'application sur la peau. La quantité de phase huileuse peut aller par exemple de 2 à 40 % en poids et de préférence de 5 à 25 % en poids par rapport au poids total de la composition, le reste de la composition étant constitué de la phase aqueuse contenant ou constituée par la dispersion aqueuse des particules de gel cubique. Le rapport en poids des composés amphiphiles constituant les particules de la phase cubique et de la phase huileuse va de préférence de 0,02/1 à 1/1, et mieux de 0,05/1 à 0,5/1.

Comme huiles utilisables dans l'invention, on peut citer les huiles minérales (huile de vaseline, mineral oil), les huiles d'origine végétale (fraction liquide du beurre de karité, huile de tournesol, huile de ricin), les huiles d'origine animale (perhydrosqualène, huile de lanoline), les huiles de synthèse (polyisobutène

hydrogénée, néopentanoate d'isostéaryle, myrsitate d'isopropyle), les huiles de silicone non volatiles ou volatiles (cyclométhicones telles que cyclopentasiloxane) et les huiles fluorées (perfluoropolyéthers). On peut aussi utiliser, comme matières grasses, des alcools gras, des acides gras, des cires. La phase huileuse de l'émulsion peut contenir aussi des gommes telles que les gommes de silicone, des résines et des cires.

5

10

15

20

25

30

35

40

45

La composition contenant une phase huileuse peut être sous forme d'une émulsion eau-dans-huile (E/H) ou huile-dans-eau (H/E). Selon un mode préféré de réalisation, elle est sous forme d'une émulsion huile-dans-eau.

De façon connue, la composition cosmétique ou dermatologique de l'invention peut contenir également des adjuvants habituels dans le domaine cosmétique, pharmaceutique ou dermatologique, tels que les gélifiants hydrophiles ou lipophiles, les actifs hydrophiles ou lipophiles, les conservateurs, les antioxydants, les solvants, les parfums, les charges, les filtres, les bactéricides, les absorbeurs d'odeur, les matières colorantes, les sels. Les quantités de ces différents adjuvants sont celles classiquement utilisées dans le domaine considéré, et par exemple de 0,01 à 10 % du poids total de la composition. Ces adjuvants, selon leur nature, peuvent être introduits dans la phase grasse, dans la phase aqueuse et/ou dans des sphérules lipidiques.

Comme actifs, la composition peut notamment contenir d'autres actifs antipollution tels que les sphingolipides (voir EP-A-0 577 718), des filtres tels que l'octocrylène et le butylméthoxydibenzoylméthane, des hydratants tels que les polyols et notamment la glycérine.

Comme gélifiants, on peut citer par exemple les dérivés de cellulose tels que l'hydroxyéthylcellulose et les alkylhydroxyéthylcelluloses telles que la cétylhydroxyéthylcellulose ; les dérivés d'algues tels que le satiagum ; les gommes naturelles telles que l'adragante ou la gomme guar ; les polymères synthétiques tels que les polymères ou copolymères carboxyvinyliques et en particulier ceux commercialisés sous les dénominations de Carbopol^R par la société Goodrich ou de Synthalen^R par la société 3V SA. La proportion en agent gélifiant va de préférence de 0,1 à 2 % du poids total de la composition.

Les compositions utilisées selon l'invention peuvent être plus ou moins fluides et avoir l'aspect d'une crème blanche ou colorée, d'une pommade, d'un lait, d'une lotion, d'un sérum, d'une pâte, d'une mousse. Elles peuvent être éventuellement appliquées sur la peau sous forme d'aérosol. Elles peuvent aussi se présenter sous forme solide, et par exemple sous forme de stick.

Les compositions utilisées selon l'invention peuvent notamment constituer un produit de soin et/ou de maquillage. Elles peuvent être utilisées notamment pour protéger l'organisme contre les effets de la pollution et/ou pour améliorer la respiration cellulaire et/ou diminuer la desquamation et/ou pour éviter de ternir ou de salir les matières kératiniques, et notamment la peau.

Ainsi, un autre objet de l'invention consiste en un procédé de traitement cosmétique en vue de protéger l'organisme contre les effets de la pollution, consistant à appliquer sur la matière kératinique, une composition contenant dans un milieu physiologiquement acceptable, une quantité efficace de phytantriol.

5

10

15

L'invention a aussi pour objet un procédé de traitement cosmétique en vue d'améliorer la respiration cellulaire et/ou diminuer la desquamation et/ou pour éviter de ternir et/ou de salir la matière kératinique, consistant à appliquer sur la matière kératinique une composition contenant dans un milieu physiologiquement acceptable, une quantité efficace de phytantriol.

Les exemples qui suivent servent à illustrer l'invention sans toutefois présenter un caractère limitatif. Les noms sont, selon le cas, en noms chimiques ou noms CTFA (International Cosmetic Ingredient Dictionary and Handbook) et les quantités en pourcentage en poids sauf mention contraire.

Exemple 1:

20	Phase A: - Phytantriol - Cetyl phosphate (commercialisé sous la dénomination	3,92	
25	de « Arlatone MAP160 » par la Société Uniqema) - Eau	0,08 1,6	% %
30	Phase B: - Polysorbate 40 (commercialisé sous la dénomination de « Montanox 40 DF » par la Société Seppic) (agent dispersant) - Triéthanolamine - Eau - Conservateur	1 0,04 55,96 0,3	%
35	Phase C: - Polyisobutène hydrogéné - Cyclohexasiloxane - Néopentanoate d'isostearyle - parfum	7,8 11,6 2,6 0,1	% % %
40	Phase D: - Cetyl hydroxyethylcellulose (commercialisé sous la dénomination de « Natrosol Plus Grade 330CS » par la Société Hercules) - Eau	1 14	% %

Mode opératoire :

45 <u>Première étape</u>:

On mélange à température ambiante les composés de la phase A. A ce mélange on ajoute à température ambiante la phase B. Le mélange est ensuite dispersé et homogénéisé à température ambiante à l'aide d'un homogénéiseur de type

« UltraTurrax T50 » muni d'une tête de dispersion 45F, à 10000 rpm pendant 30 minutes.

Deuxième étape :

A la dispersion aqueuse de phytantriol, obtenue ci-dessus, on ajoute le mélange huileux de la phase C. Le mélange est alors homogénéisé à température ambiante à l'aide d'un homogénéiseur haute pression par 4 passages à 600 bars.

Troisième étape :

La préparation obtenue à la deuxième étape est gélifiée à l'aide du mélange de la phase D. On homogénéise alors le mélange à température ambiante à l'aide d'un homogénéiseur à pale pendant 30 minutes. On obtient une crème homogène et stable qui s'applique facilement sur la peau et la protège de la pollution.

15			
	Exemple A (comparatif) : Emulsion huile dans eau		
	- Polyisobutène hydrogéné	7,8	%
	- Cyclohexasiloxane	11,6	%
	- Néopentanoate d'isostearyle	2,6	%
20	- Conservateurs	0,5	%
20	- Gomme de xanthane	0,6	%
	- Polyacrylamide / C13-14 isoparaffin / laureth-7 (Sepigel 305	·	
	commercialisé par la société SEPPIC)	2	%
	- Diméthicone copolyol (DC2-5695, Dow Corning)	3	%
25	- Glycérine	3	%
23	- Eau	qsp 100	%
	- Lau 	777	
	Exemple B (comparatif) : Emulsion eau dans huile	7.0	0/
30	- Polyisobutène hydrogéné	7,8	%
	- Cyclohexasiloxane	11,7	%
	- Néopentanoate d'isostearyle	2,6	%
	- Chlorure de sodium	0,6	%
	 Cétyldiméthicone copolyol (Abil EM90, Goldschmidt) 	3	%
35	- Glycérine	3	%
	- Eau	qsp 100	%

Test pour la mise en évidence in vitro de l'effet protecteur du phytantriol 40 Efficacité anti-pollution sur peau reconstruite

Les compositions de l'exemple 1 et des exemples comparatifs A et B ont été appliquées à la surface des épidermes de peau reconstruite (2 mg/cm²) et laissées à leur contact pendant 30 minutes à température ambiante. Des particules radio-marquées au carbone 14 ont été ensuite déposées sur les épidermes et laissées à leur contact pendant 2 heures dans le milieu de maintenance habituelles des épidermes. Puis les épidermes ont été retirés de leur milieu de maintenance et lavés plusieurs fois au tampon PBS (Phosphate Buffer

Solution). Les lavages permettent de débarrasser les épidermes des particules faiblement adsorbées sans éliminer la composition initialement appliquée. Les taux de particules radio-marquées résiduels ont été ensuite évalués par la mesure de la radioactivité du carbone 14 additionné aux particules. Le tableau ci-dessous donne les résultats en pourcentage de particules résiduelles par rapport à la quantité de particules déposées

	% par rapport à la quantité de particules déposées		
Zone non traitée	36,2 ± 2,83%		
Zone traitée avec composition de l'exemple 1	3,3 ± 0,66		
Zone traitée avec émulsion de l'exemple A (comparatif)	11,3 ± 0,65		
Zone traitée avec émulsion de l'exemple B (comparatif)	11,2 ±2,10		

10 Ces résultats montrent que les compositions contenant du phytantriol, utilisées selon l'invention permettent une meilleure protection de la peau contre les particules polluantes que les émulsions classiques, en limitant la pénétration des particules polluantes externes.

Exemple 2 : Fluide (émulsion H/E)

Selon le même mode opératoire que pour l'exemple 1, on a préparé un fluide de jour sous forme d'une dispersion par mélange des parties suivantes :

20	Phase	Α	:
----	-------	---	---

15

25

5

- Phytantriol	2,97 %
- Stéaroylglutamate de monosodium, commercialisé sous la	
dénomination Acylglutamate HS-11 par la Société Ajinomoto	0,03 %
- Eau	1,25 %

Phase B:

	de « Montanox 40 DF » par la Société Seppic) (agent dispersant)	0,75	%
	- Glycérine	4	%
30	- Propylène glycol	4	%
	- Eau	55,8	%
	- Conservateur	0.2	%

- Polysorbate 40 (commercialisé sous la dénomination

Phase C:

35	- Octocrylène	, ·	8,4	%
	- Butyl méthoxydibenzoylméthane		3,6	%
	- Dimethicone (DC200 Fluid 1.5 cSt)		4	%

	Néopentanoate d'isostearyleMyristate d'isopropyle		2 2	% %
	Phase D :			· M
_	- Conservateur		1	%
5	_	,	40	, •
	- Eau		10	%

On obtient une composition fluide qui peut être appliquée sous forme d'un spray et qui permet une bonne protection de la peau contre les polluants.

Exemple 3 : Emulsion huile dans eau

10

	Phase A :			
15	- PEG-20 Stearate	4,5	%	
	- Phytantriol	3	%	
	- Sel di-sodique de l'acide N-stearoyl glutamique	0,5	%	
	- Mineral oil	10,51	%	
	- Huile de ricin	2,09	%	
20	- Huile de vaseline	1,94	%	
	- Myristate d'isopropyle	1,39	%	
	- Huile de lanoline	1,07	%	
	Phase B :			
25	- Eau	69	%	
	- Glycerine	5	%	
	- Conservateur	1	%	

On obtient une composition fluide qui permet une bonne protection de la peau contre les particules polluantes.

REVENDICATIONS

1. Utilisation cosmétique du phytantriol comme agent anti-pollution, dans une composition pour application topique sur les matières kératiniques.

2. Utilisation du phytantriol pour la préparation d'une composition à application topique destinée à protéger la matière kératinique contre les effets nocifs de la pollution.

10 3. Utilisation selon la revendication 1 ou 2, caractérisée par le fait que le phytantriol est présent en une quantité allant de 0,001 à 20 % en poids et de préférence de 0,1 à 10 % en poids par rapport au poids total de la composition.

5

20

- Utilisation selon l'une quelconque des revendications précédentes,
 caractérisée par le fait que la composition contenant le phytantriol est une émulsion.
 - 5. Utilisation selon l'une quelconque des revendications 1 à 3, caractérisée par le fait que le phytantriol est sous forme de particules de gel cubique.
 - 6. Utilisation selon la revendication précédente, caractérisée par le fait que les particules de gel cubique sont en dispersion aqueuse.
- 7. Utilisation selon la revendication précédente, caractérisée par le fait que les particules de gel cubique sont essentiellement formées par :

 (i) 0,1 à 15 % en poids par rapport au poids total de la composition, de phytantriol ou d'un mélange de phytantriol avec un composé choisi parmi les dérivés N-2-alcoxycarbonyles de N-méthylglucamine et les monoglycérides d'acide gras insaturé, et
- 30 (ii) 0,05 à 3 % en poids par rapport au poids total de la composition, d'au moins un agent dispersant et stabilisant, ledit agent étant choisi parmi les agents tensioactifs hydrosolubles à température ambiante, contenant une chaîne grasse, saturée ou insaturée, linéaire ou ramifiée, ayant de 8 à 22 atomes de carbone.
- 35 8. Utilisation selon la revendication précédente, caractérisée par le fait que la proportion pondérale relative en composé (i) par rapport au poids dudit agent dispersant et stabilisant (ii) va de 2 à 200.
- 9. Utilisation selon la revendication 7 ou 8, caractérisée par le fait que ledit 40 dérivé N-2-alcoxycarbonyle de N-méthylglucamine répond à la formule (I) suivante :

$$\begin{array}{c} \text{R-O-CO-} \text{N-CH}_2\text{-}(\text{CHOH})_4\text{-}\text{CH}_2\text{OH} \end{array} (I) \\ \text{CH}_3 \end{array}$$

dans laquelle R représente un radical alkyle ramifié comportant de 6 à 18 atomes de carbone.

- 10. Utilisation selon l'une quelconque des revendications 7 à 9, caractérisée par le fait que ledit dérivé N-2-alcoxycarbonyle de N-méthyl-glucamine est choisi parmi la N-2-hexyldécyloxycarbonyl-N-méthyl-glucamine, la N-2-éthylhexyloxycarbonyl-N-méthyl-glucamine, la N-2-butyloctyloxycarbonyl-N-méthyl-glucamine et leurs mélanges.
- 11. Utilisation selon l'une quelconque des revendications 7 à 10, caractérisée par le fait que les particules de gel cubique contiennent comme composé (i), un mélange constitué de 1 à 40 % en poids de phytantriol par rapport au poids du mélange et de 60 à 99 % en poids de dérivé N-2-alcoxycarbonyle de N-méthylglucamine par rapport au poids du mélange.
- 12. Utilisation selon la revendication 7, caractérisée par le fait que ledit 15 monoglycéride d'acide gras insaturé est choisi parmi le monooléate de glycéryle et le monolinoléate de glycéryle.
- 13. Utilisation selon la revendication 7, caractérisée par le fait que les particules de gel cubique contiennent comme composé (i) un mélange constitué de 1 à 50 %
 20 en poids de phytantriol par rapport au poids du mélange, et de 50 à 99 % en poids de monoglycéride d'acide gras insaturé par rapport au poids du mélange.
 - 14. Utilisation selon l'une quelconque des revendications 7 à 13, caractérisée par le fait que ledit agent dispersant et stabilisant est choisi parmi :
- 25 (1) les alkyl ou alcényl éthers ou esters de polyol,
 - (2) les amino-acides N-acylés et leurs dérivés et les peptides N-acylés par un radical alkyle ou alcényle, et leurs sels,
 - (3) les alkyl ou alcényl éthers ou esters sulfates, leurs dérivés et leurs sels,
 - (4) les alkyl ou alcényl éthers ou esters gras polyoxyéthylénés,
- 30 (5) les acides alkyl ou alcényl carboxyliques polyoxyéthylénés et leurs sels,
 - (6) les N-alkyl ou alcényl bétaïnes,
 - (7) les alkyl ou alcényl triméthylammonium et leurs sels, et
 - (8) leurs mélanges.

5

- 15. Utilisation selon l'une quelconque des revendications 5 à 14, caractérisée par le fait que les particules de gel cubique ont une taille allant de 0,05 µm à 1 µm.
- 16. Utilisation selon l'une quelconque des revendications 6 à 15, caractérisée par le fait que la dispersion de particules de gel cubique contient en outre au moins un
 40 lipide amphiphile ionique non hydrosoluble.
 - 17. Utilisation selon la revendication précédente, caractérisée par le fait que ledit lipide amphiphile ionique non hydrosoluble est choisi parmi :
 - (i) les phospholipides,
- 45 (ii) les esters phosphoriques d'acide gras,
 - (iii) les dérivés N-acylés de l'acide glutamique non hydrosolubles et leurs sels,
 - (iv) le cétylsulfate de sodium,
 - (v) le cocoyl monoglycéride sulfate de sodium, et

(vi) les dérivés d'ammonium quaternaire non hydrosolubles.

. 5

10

30

- 18. Utilisation selon l'une quelconque des revendications 5 à 17, caractérisée par le fait que les particules contiennent au moins un principe actif hydrophile et/ou lipophile.
- 19. Utilisation selon l'une quelconque des revendications 5 à 17, caractérisée par le fait que les particules de gel cubique sont présentes en une quantité allant de 0,1 à 20 % en poids par rapport au poids total de la composition.
- 20. Procédé de traitement cosmétique en vue de protéger l'organisme contre les effets de la pollution, consistant à appliquer sur la matière kératinique, une composition contenant dans un milieu physiologiquement acceptable, une quantité efficace de phytantriol.
- 21. Procédé de traitement cosmétique en vue d'améliorer la respiration cellulaire et/ou diminuer la desquamation et/ou pour éviter de ternir et/ou de salir la matière kératinique, consistant à appliquer sur la matière kératinique, une composition contenant dans un milieu physiologiquement acceptable, une quantité efficace de phytantriol.
 - 22. Procédé selon la revendication 20 ou 21, caractérisé par le fait que la composition contenant le phytantriol est une émulsion.
- 25 23. Procédé selon la revndication 20 ou 21, caractérisé par le fait que le phytantriol est sous forme de particules de gel cubique.
 - 24. Procédé selon l'une quelconque des revendications 20 à 23, caractérisé par le fait que la matière kératinique est la peau.

•			
		•	
	•		
			1
		·	
			医电光管 等地震
er e			f.

DOCKET NO. 208594400 OBLON, SPIVAK, MCCLELLAND, MAIER & NEUSTADT, P.C.

ATTORNEYS AT LAW FOURTH FLOOR

1755 JEFFERSON DAVIS HIGHWAY ARLINGTON, VIRGINIA 22202 U.S.A.

Invertor Bruno BIATRY FILLIOG DATE: HETELDITH